

**Substituted imidazo[1,5-A]pyridine derivatives as aromatase inhibitors**

Patent  
Number: ☐ US4617307

Publication  
date: 1986-10-14

Inventor(s): BROWNE LESLIE J (US)

Applicant(s): CIBA GEIGY CORP (US)

Requested  
Patent: ☐ EP0165904, A3, B1

Application  
Number: US19840622421 19840620



Priority  
Number(s): US19840622421 19840620

IPC  
Classification: A61K31/44; C07D471/04

EC  
Classification: C07D471/04, C07D213/55, C07D213/84E, C07D233/54C2D1, C07D233/54C2D2,  
C07D233/54C2D5, C07D487/04, C07F7/10, C07F7/18C4D4D

Equivalents: AU4385785, AU589565, ☐ BG60262, ☐ BG60305, ☐ BG60306, ☐ BG60307,  
☐ BG60352, ☐ BG60353, ☐ BG60402, CA1276633, CS8504449, CY1750,  
☐ DD237510, DE3582452D, ☐ DK170302B, ☐ DK277685, ☐ ES8702406,  
☐ ES8800681, ☐ ES8801262, ☐ ES8802048, ☐ ES8802049, ☐ ES8802155,  
☐ FI80694B, ☐ FI80694C, FI852399, ☐ GR851487, HK23494, HU37936, ☐ IE58070,  
IL75546, JP1724559C, JP4007746B, ☐ JP61012688, KR9008566, MX9203369,  
NO162467B, NO162467C, NO852474, NZ212483, PH23390, PL145103B, PL145104B,  
PL145105B, PL145348B, PL145814B, PL254099, ☐ PT80661, RO92583, ☐ SU1433413,  
SU1436878, SU1436879, SU1436880, ☐ SU1443802, ☐ SU1482530, ZA8504615

**Abstract**

Compounds of the formula  (Ia) wherein R1 represents cyano, nitro or C1-C4-alkyl or the 7,8-dihydro derivative thereof or the 5,6,7,8 tetrahydro derivative of the formula  (Ib) wherein R1 is as defined under formula Ia and R2 is hydrogen, C1-C4-alkyl, halogen etherified or esterified hydroxy or mercapto, carboxy-C1-C4-alkyl or C1-C4-alkoxycarbonyl-C1-C4-alkyl or C1-C4-alkanoyl, to stereoisomers, mixtures of these stereoisomers and salts of these compounds are disclosed as well as their preparation, pharmaceutical compositions containing the same and the use thereof as inhibitors of aromatase activity.

Data supplied from the esp@cenet database - I2

19



Europäisches Patentamt  
European Patent Office  
Office européen des brevets



11 Veröffentlichungsnummer: **0 165 904 B1**

12

## EUROPÄISCHE PATENTSCHRIFT

45 Veröffentlichungstag der Patentschrift: 10.04.91

21 Anmeldenummer: 85810279.1

22 Anmeldetag: 17.06.85

51 Int. Cl.<sup>5</sup>: **A61K 31/435**, A61K 31/415,  
A61K 31/55, A61K 31/395,  
C07D 471/04, C07D 487/04,  
/(C07D471/04,235:00,221:00),  
(C07D487/04,235:00,209:00),  
(C07D487/04,235:00,223:00)

54 Substituierte bicyclische Verbindungen.

30 Priorität: 20.06.84 US 622421

43 Veröffentlichungstag der Anmeldung:  
27.12.85 Patentblatt 85/52

45 Bekanntmachung des Hinweises auf die  
Patenterteilung:  
10.04.91 Patentblatt 91/15

84 Benannte Vertragsstaaten:  
**AT BE CH DE FR GB IT LI LU NL SE**

56 Entgegenhaltungen:  
**EP-A- 0 068 386**  
**EP-A- 0 114 573**

Brodie et al, Endocrinology, vol.104, pp  
118-121,(1979)

Camacho et al., JAMA, vol. 202, pp 114-120  
(1967)

Foster et al., Journal Med. Chem., vol. 26, pp.

50-54 (1983)

73 Patentinhaber: **CIBA-GEIGY AG**  
**Klybeckstrasse 141**  
**CH-4002 Basel(CH)**

72 Erfinder: **Browne, Leslie J. Dr.**  
**41 Malapardis Road**  
**Morris Plains New Jersey 07950(US)**

**EP 0 165 904 B1**

Anmerkung: Innerhalb von neun Monaten nach der Bekanntmachung des Hinweises auf die Erteilung des europäischen Patents kann jedermann beim Europäischen Patentamt gegen das erteilte europäische Patent Einspruch einlegen. Der Einspruch ist schriftlich einzureichen und zu begründen. Er gilt erst als eingelegt, wenn die Einspruchsgebühr entrichtet worden ist (Art. 99(1) Europäisches Patentübereinkommen).